

## РЕГИОСЕЛЕКТИВНЫЙ СИНТЕЗ АЗОЛО[5,1-С][1,2,4]ТРИАЗИНОВ

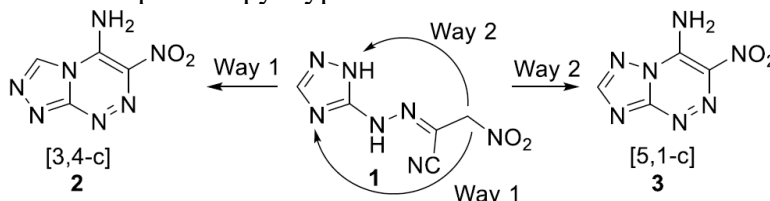
**Е. К. Воинков<sup>1</sup>, Р. А. Дрокин<sup>1</sup>, Е. Н. Уломский<sup>1,2</sup>, В. Л. Русинов<sup>1,2</sup>**

<sup>1</sup> Уральский федеральный университет имени первого Президента Б. Н. Ельцина, 620002, Россия, г. Екатеринбург, ул. Мира, 19

<sup>2</sup> Институт органического синтеза им. И. Я. Постовского УрО РАН, 620990, Россия, г. Екатеринбург, ул. С. Ковалевской, 22 / Академическая, 20

E-mail: voinkov-egor@mail.ru

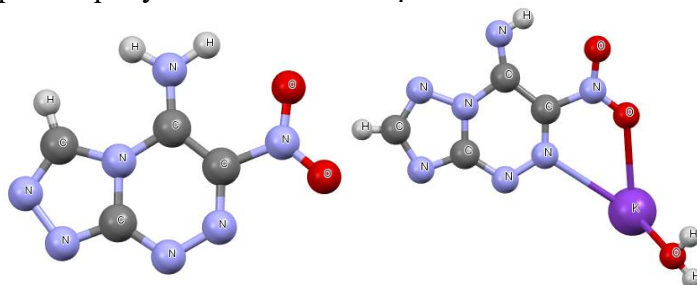
Азоло[5,1-с][1,2,4]триазины как класс известны уже давно и зарекомендовали себя в качестве перспективных биологически активных соединений<sup>1</sup>. Наиболее распространенный способ их синтеза заключается в аннелировании 1,2,4-триазинового кольца к разнообразным диазоазолам. Однако циклизация гидразона **1**, получаемого при сочетании с 3-диазо-1,2,4-триазолом, может протекать по двум путям: с образованием 1,2,4-триазоло[3,4-с][1,2,4]триазина и 1,2,4-триазоло[5,1-с][1,2,4]триазина (схема 1). Ранее эта проблема не была обозначена, а авторы не доказывали полученные изомерные структуры.



Было установлено, что синтез 3-нитро-4-амино-1,2,4-триазоло[5,1-с][1,2,4]триазина, традиционно получаемого термической циклизацией соответствующего гидразона, сопровождается образованием альтернативного [3,4-с]-изомера в соотношении 1:1. Таким образом, задача настоящего исследования заключается в снижении температурного влияния на циклизацию и выявление оптимальных условий образования 3-нитро-4-амино-1,2,4-триазоло[5,1-с][1,2,4]триазина.

Нами был испытан ряд условий циклизации гидразона **1** и подобраны оптимальные условия проведения процесса. Было установлено, что преимущественно [5,1-с]-изомер образуется при нагревании в присутствии пара-толуолсульфокислоты, смеси уксусной кислоты и пиридина или при микроволновом облучении. Однако проведение циклизации при температуре выше 100°C приводит к образованию смеси изомерных продуктов.

Строение изомерных продуктов было подтверждено методом РСА (рис. 1).



**Рисунок 1** – Изображения 3-нитро-4-аминоазоло[3,4-с][1,2,4]триазина и калиевой соли 3-нитро-4-аминоазоло[5,1-с][1,2,4]триазина, полученные методом РСА

Таким образом, был разработан метод синтеза 3-нитро-4-аминоазоло[5,1-с][1,2,4]триазина с выходом 86% без образования побочного [3,4-с]-изомера. Оптимальными условиями циклизации является нагревание гидразона **1** в эквимольной смеси уксусной кислоты и пиридина при 100°C.

#### Библиографический список

1. Русинов В. Л. Биологически активные азоло-1,2,4-триазины и азолопиримидины / В. Л. Русинов, В. Н. Чарушин, О. Н. Чупахин // Известия АН, серия химическая. – 2018. – № 4. – С. 573–599.